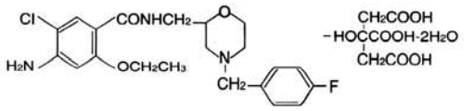
“信東”摩暢 膜衣錠 5 毫克
Mosa F.C. Tablets 5mg

【成分組成】
主成分：Each F.C. Tablet Contains:
Mosapride Citrate Dihydrate ……5.29mg
(Eq. to Mosapride Citrate……5mg)
賦形劑：Lactose Monohydrate、Corn Starch、Low Substituted Hydroxypropyl Cellulose、Hydroxypropyl Cellulose、Colloidal Silicon Dioxide、Magnesium Stearate、Hydroxypropyl Methylcellulose、Copovidone、Polyethylene Glycol、Titanium Dioxide。

結構式：



一般名：Mosapride Citrate
化學名：(±)-4-amino-5-chloro-2-ethoxy-N-[[4-(4- fluorobenzyl)-2-morpholinyl] methyl] benzamide citrate dihydrate
分子式：$C_{21}H_{25}ClFN_3O_3 \cdot C_6H_8O_7 \cdot 2H_2O$
分子量：650.05
分布係數：在室溫，pH值為 7.0 的條件下，氯仿與水溶液的分布係數為 9.1×10^2。
描述：Mosapride citrate dihydrate 為白色或微黃色的白色晶體粉末，沒有臭味，稍帶苦味，易溶於 N, N-dimethyl-formamide、pyridine 或 100%的醋酸，略溶解於甲醇，微溶於 95%的乙醇)及無水醋酸，幾乎完全不溶於水及 diethylether。

【適應症】
消化器官蠕動機能異常引起之不適症狀，包括心窩灼熱、噁心、嘔吐。

【用法・用量】
本藥須由醫師處方使用。
一般成人一日 15mg 分三次於飯前或飯後經口服用。

【警語及注意事項】依文獻記載
1.重要的基本注意事項
本藥品與心臟節律藥物併用時應注意監測其心電圖，如有心律不整之情形發生時，應予減少使用劑量或停藥。
若服藥經過一定期間（通常為二星期）症狀仍然不見改善時，則請勿再繼續長期服用。

2.交互作用
(1) Mosapride Citrate 與以下藥品併用時須小心注意：

藥品名稱	臨床症狀 處置方法	機轉、危險因子
具有抗膽鹼作用的藥品，如：硫酸阿托平(atropine)、溴化丁基東莨菪鹼(butylscopolamine)等。	若是同時有服用抗膽鹼藥品時，由於可能降低本藥的作用，請注意服用時間的間隔。	由於本藥是經由膽鹼的作用促進消化道蠕動，故若和抗膽鹼藥物併用，會抑制本藥的作用。

(2) Mosapride Citrate 主要是利用肝臟酵素 CYP3A4 進行代謝。當與其他會影響 CYP3A4 活性的藥物一起服用時，會使 mosapride 在體內的藥物濃度改變，例如與 CYP3A4 抑制劑併用時，會使 mosapride 在體內濃度提高。因此，當必須同時服用多種藥物時，必須注意是否會引起藥物在人體體內濃度變化。

3.副作用
在九百九十八個病例中，有四十個病例發現副作用(占 4.0%)。其主要的副作用為下痢、軟便(1.8%)、口渴(0.5%)、倦怠感(0.3%)等。在臨床檢查值中，七百九十二個病例中有三十個案例發現症狀異常狀況(占 3.8%)。其主要的症狀為嗜酸球增多(1.1%)、三酸甘油脂上昇(1.0%)、GOT、GPT、ALP 及 γ-GTP 值上昇(各占 0.4%)等。

(1) 臨床上重大的副作用
猛爆性肝炎，肝功能障礙與黃膽(發生率均小於 0.1%)有時會發生致命性的猛爆性肝炎與嚴重的肝功能障礙，他們會伴隨著顯著的 GOT、GPT、ALP 及 γ-GTP 數值上昇，偶爾也可能發生黃膽現象。如果病人有發生任何的不正常，應該要馬上停止服用藥物並小心監測其生化數值。

(2) 其他副作用

分　類	0.1~5%	頻率不明
過敏症狀	水腫	發疹、蕁麻疹
血液學	嗜伊紅血球增多、白血球減少	
消化器官	下痢、軟便、口渴、腹痛、噁心、嘔吐、味覺異常	腹脹、口腔失去知覺(包括舌頭與嘴唇等)
肝　臟	GOT、GPT、ALP、γ-GTP 及 bilirubin 數值上昇	
循環器官	心悸亢奮	
精神與神經方面	頭昏、頭痛	
其　他	倦怠感、三酸甘油脂上昇	震顫

4.對高齡者的投藥方式
一般由於高齡者的肝、腎功能等生理功能相較於一般人為低，故需仔細觀察患者的狀態，慎重投藥。若發生副作用時，可減少用藥量(例如一天給與 7.5mg)等。

5.對孕婦、產婦、哺乳婦女等的投藥方式
(1) 對孕婦或是有可能懷孕的婦女，應在判斷投藥治療的效益遠超過危險性時，才能開具此藥。(因為本藥對懷孕中婦女的安全性尚未經證實)
(2) 避免開本藥給哺乳中的婦女，若不得不採用本藥時，應要求該婦女暫停授乳。(有動物實驗報告指出藥物可能滲入乳汁中(老鼠實驗)

6.對兒童的用藥
本藥對兒童的安全性尚未確知(因尚無使用經驗)。

7.使用時之注意事項
交付藥劑時應指導患者將本藥從 PTP 包裝的外裝中取出服用。【曾有報告指出誤吞外包裝時，其堅硬的銳角部份可能會刺入食道粘膜，進而造成食道穿孔及縱隔洞炎等嚴重的合併症狀】

8.其他注意事項
對齧齒類動物以臨床通常使用量的 100~300 倍用量(30~100mg/kg/day)長時間經口投與的實驗後(大鼠 104 星期、小鼠 92 星期)，發現其腫瘤發生率(肝細胞腫瘤及甲狀腺濾泡性腫瘤)有上昇的狀況。

【藥物動力學】依文獻記載
1.血漿中濃度
(5 位健康的成人空腹時服用一次 mosapride citrate 5mg)

T_{max} (h)	C_{max} (ng/mL)	$t_{1/2}$ (h)
0.8±0.1	30.7±2.7	2.0±0.2

Mean±standard error

2.血漿蛋白結合率
99.0%(in vitro, 人類血清，濃度 1μg/mL)

3.主要的代謝產物及代謝路徑
主要代謝產物：des-4-fluorobenzyl metabolite。
代謝路徑：本藥主要是經由肝臟代謝(先將 4-fluorobenzyl 官能基移除，緊接在 morpholine 環的第 5 個位置進行氧化反應；在苯環的第 3 個位置進行氫氧化反應)。

4.排泄路徑及排泄率(指健康成人，空腹時給與一次 mosapride citrate 5mg。)
排泄路徑：尿液及糞便。
排泄率：投藥後四十八小時的尿中排泄率，其原型占 0.1%。主要的代謝物質為(des-4-fluorobenzyl mosapride)占 7.0%。

5.代謝酵素
細胞色素(cytochrome)P-450：主要為 CYP3A4
於健康志願者每日投與mosapride 15mg 併用erythromycin 1200mg，較單獨服用 mosapride 時，其 mosapride 的最高血中濃度會從 42.1ng/mL 昇高到 65.7ng/mL，其半衰期會從 1.6 小時延長至 2.4 小時，其AUC_{0-4}會從 62ng・hr/mL，增加到 114ng・hr/mL。
於 30 位健康志願者每日三次投與 mosapride 30mg (90mg/day)，併用 ketoconazole 200mg 每日一次，結果顯示併用 ketoconazole 試驗組的 mosapride 血中濃度高於未併用 ketoconazole 的對照組的 2 倍。但對於心電圖 QTc 間隔距離並無明顯之影響。
於體外試驗中投與warfarin、diazepam及digoxin於含 1μg/mL^{14}C mosapride citrate之人體血漿蛋白(HAS)，結果各有 59.1%、57.9%及 54.8%之^{14}C mosapride citrate結合於血漿蛋白，顯示與未併用warfarin、diazepam及digoxin時之血漿蛋白結合率 58.0%相似，並無明顯差異。

【臨床實驗】依文獻記載
在隨機、雙盲、cisapride 對照組比較設計的臨床試驗，mosapride 在對於腸胃道不適症狀的改善程度與 cisapride 同樣 70%以上的效果；而整體評估方面，兩組的結果也相近(74.8% vs 75%)。
累計臨床試驗第一期至第三期服用 mosapride 的實驗人數(435 個案例)的臨床試驗，針對慢性胃炎症狀的療效結果如下所示：

疾病及症狀		改善率
慢性胃炎	胸悶	74% (130/176)
	噁心、嘔吐	77% (150/196)

【藥效及藥理】依文獻記載
1.臨床藥理
以健康成人及慢性胃炎患者為對象做胃排出實驗，投與本藥 5mg，顯示有促進胃排出作用。

2.消化道蠕動促進作用
對清醒的狗在其餐後，促進其胃及十二指腸的蠕動，但對其結腸運動幾乎完全沒有影響。

3.促進胃排出作用
對大鼠及小鼠的實驗中顯示，具有促進胃部對液體的排出作用，及對固型物的排出作用(大鼠)，同時在連續一週反複投藥後，其促進胃排出作用會減弱(大鼠)。

4.作用機制
本藥是選擇性的serotonin 5-HT_4促進劑，會刺激存在消化道內的神經叢中的 5-HT_4受體，藉由增加Acetylcholine的游離，因而顯示出促進消化道蠕動及胃排出作用等。

【保存條件】
儲存於室溫 25℃以下。
須置於小孩接觸不到之處。

【包裝】
6~1000 粒塑膠瓶裝、鋁箔盒裝。

衛署藥製字第 055990 號

信東生技股份有限公司
桃園市桃園區介壽路 22 號

54130650 ②